

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2000-1487

(P2000-1487A)

(43)公開日 平成12年1月7日(2000.1.7)

(51)Int.Cl.⁷

識別記号

F I

テーマコード⁸(参考)

C 07 D 417/12

C 07 D 417/12

A 61 P 3/10

A 61 K 31/00

603N

3/04

603K

3/06

603L

9/10

609G

審査請求 有 請求項の数27 O L (全168頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願平11-150312

(71)出願人 000001856

(62)分割の表示 特願平8-137930の分割

三共株式会社

(22)出願日 平成8年5月31日(1996.5.31)

東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号

(31)優先権主張番号 特願平7-135097

(72)発明者 藤田 岳

(32)優先日 平成7年6月1日(1995.6.1)

東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内

(33)優先権主張国 日本 (JP)

(72)発明者 和田 邦雄

(31)優先権主張番号 特願平8-45845

東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内

(32)優先日 平成8年3月4日(1996.3.4)

(74)代理人 100081400

(33)優先権主張国 日本 (JP)

弁理士 大野 彰夫 (外2名)

最終頁に続く

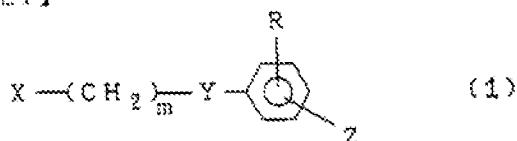
(54)【発明の名称】 総合複素環誘導体

(57)【要約】

【課題】 優れた血糖低下作用等を有する総合複素環化合物の提供。

【解決手段】 一般式 (1)

【化1】

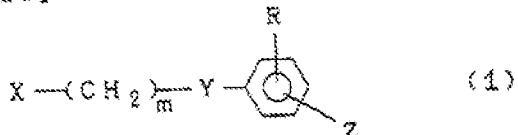


を有する総合複素環化合物またはその塩。(式中、Xはベンズイミダゾール環基を示し、該基は1ないし5個の後述する置換分(a)を有していてもよい。Yは酸素原子などを示す。Zはチアゾリジン-2,4-ジオン-5-イルメチル基などを示す。Rは水素原子などを示す。mは1ないし5の整数を示す。置換分(a)はアルキル基などを示す。

【特許請求の範囲】

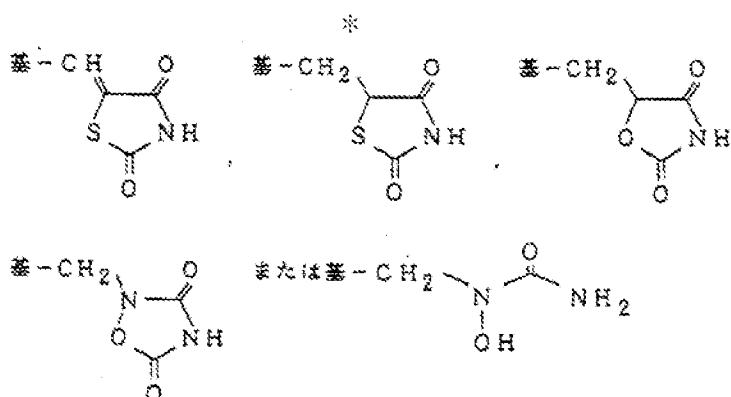
【請求項1】 一般式(1)

【化1】



*を有する縮合複素環化合物またはその塩、上記式中、
Xはベンズイミダゾール環基を示し、該基は1ないし5
個の後述する置換分(a)を有していてもよい。Yは酸
素原子または硫黄原子を示す。Zは

【化2】



を示す。Rは水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、置換分(b)を有していてもよいアミノ基(該置換分(b)は炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基、炭素数6ないし10個を有するアリール基、炭素数1ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基、炭素数8ないし12個を有する芳香脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す。)または炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基を示す。mは1ないし5の整数を示す。ここに、置換分(a)は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アセトキシ基、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ニトロ基、置換分(b)を有していてもよいアミノ基(該置換分(b)は炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基、炭素数6ないし10個を有するアリール基、炭素数1ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基、炭素数8ないし12個を有する芳香脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す。)、置換分(c)を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基(該置換分(c)は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子を示す。)。

20 キル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、フェニル基、トリフルオロメチル基、置換分(b)を有していてもよいアミノ基)、または置換分(c)を有していてもよい炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基を示す。但し、上記縮合複素環化合物またはその塩から、5-[4-(6-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩を除く。

30 【請求項2】 【請求項1】において、Rが水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項3】 【請求項1】において、Yが酸素原子である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項4】 【請求項1】において、Zが2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基、2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基または2,4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項5】 【請求項1】において、Rが水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子であり、Yが酸素原子であり、

Zが2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基、2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基または2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基。

ルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項6】 【請求項1】において、Zが2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基または2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項7】 【請求項1】において、Rが水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子または塩素原子である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項8】 【請求項1】において、mが1ないし3の整数である縮合複素環化合物またはその塩。 10

【請求項9】 【請求項1】において、

Yが酸素原子であり、

Zが2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基または2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基であり、

Rが水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子または塩素原子であり、

mが1ないし3の整数である縮合複素環化合物またはその塩。 20

【請求項10】 【請求項1】において、Xが1ないし5個の下記置換分(a')を有していてもよいベンズイミダゾール環基；置換分(a')は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である、である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項11】 【請求項1】において、Zが2, 4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩。 30

【請求項12】 【請求項1】において、Rが水素原子、メチル基またはメトキシ基である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項13】 【請求項1】において、
Xが1ないし5個の下記置換分(a')を有していてもよいベンズイミダゾール環基；置換分(a')は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である、であり、

Yが酸素原子であり、

Zが2, 4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基であり、

Rが水素原子、メチル基またはメトキシ基であり、

の塩。

【請求項14】 【請求項1】において、Xが1ないし5個の下記置換分(a'')を有していてもよいベンズイミダゾール環基；置換分(a'')はメチル基、エチル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ベンジルオキシ基、フッ素原子、塩素原子、フェニルチオ基、メチルチオ基、エチルチオ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である、である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項15】 【請求項1】において、Rが水素原子である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項16】 【請求項1】において、mが1または2である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項17】 【請求項1】において、
Xが1ないし5個の下記置換分(a'')を有していてもよいベンズイミダゾール環基；置換分(a'')はメチル基、エチル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ベンジルオキシ基、フッ素原子、塩素原子、フェニルチオ基、メチルチオ基、エチルチオ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である、であり、

Yが酸素原子であり、

Zが2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基であり、

Rが水素原子であり、

mが1または2である縮合複素環化合物またはその塩。 40

【請求項18】 【請求項1】において、Xが1ないし5個の下記置換分(a''')を有していてもよいベンズイミダゾール環基；置換分(a''')はメチル基、メトキシ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基またはベンジル基である、である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項19】 【請求項1】において、mが1である縮合複素環化合物またはその塩。

【請求項20】 【請求項1】において、
Xが1ないし5個の下記置換分(a''')を有していてもよいベンズイミダゾール環基；置換分(a''')はメチル基、メトキシ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基またはベンジル基である、であり、

Yが酸素原子であり、

Zが2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基であり、

Rが水素原子であり、

mが1である縮合複素環化合物またはその塩。 50

【請求項21】 5-[4-(1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2, 4-ジオンまたはその塩、

5-[4-(5-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2, 4-ジオンまたはその塩、

5-[4-(1-ベンジルベンズイミダゾール-5-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩、

5-[4-(5-ヒドロキシ-1,4,6,7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩、あるいは5-[4-(5-アセトキシ-1,4,6,7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩。

【請求項22】 5-[4-(1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩。

【請求項23】 5-[4-(5-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩。

【請求項24】 5-[4-(1-ベンジルベンズイミダゾール-5-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩。

【請求項25】 5-[4-(5-ヒドロキシ-1,4,6,7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩。

【請求項26】 5-[4-(5-アセトキシ-1,4,6,7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル]チアゾリジン-2,4-ジオンまたはその塩。

【請求項27】 【請求項1】ないし【請求項26】のいずれか1項に記載された縮合複素環化合物もしくはその塩を有効成分として含有する医薬。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明はインスリン抵抗性、高脂血症、高血糖症、妊娠糖尿病(gestational diabetes mellitus: GDM)、肥満症、耐糖能不全(impaired glucose tolerance: IGT)状態、糖尿病合併症(例えば網膜症、腎症、神経症、白内障、動脈硬化症等)、動脈硬化症、白内障および多囊胞卵巣症候群(polycystic ovary syndrome: PCOS)等を改善し、更にアルドース還元酵素阻害作用、5-リボキシゲナーゼ阻害作用および過酸化脂質生成抑制作用を有する新規な縮合複素環化合物またはその塩に関する。

【0002】更に本発明は、縮合複素環化合物またはその塩を有効成分として含有する、高脂血症、高血糖症、肥満症、耐糖能不全、高血圧症、骨粗鬆症、悪液質、脂肪肝、糖尿病合併症、動脈硬化症、白内障等の予防薬および/または治療薬、および上記疾病以外の、妊娠糖尿病、多囊胞卵巣症候群等のようなインスリン抵抗性に起因する疾病的予防薬および/または治療薬、ならびに炎症性疾患(例えば骨關節炎)、疼痛、発熱、リウマチ性疾患等の疾患に対する薬。

疹、アレルギー性疾患、喘息、G1潰瘍、心血管性疾患(例えば虚血性心疾患等)、アテローム性動脈硬化症および虚血性疾患により惹起される細胞損傷(例えば卒中により惹起される脳損傷等)等の予防薬および/または治療薬に関する。

【0003】

【従来の技術】従来、糖尿病、高血糖症治療薬として、インシュリンおよびトリプタミド、グリビジド等のスルホニル脲素化合物が使用されているが、最近、インシュリン非依存性糖尿病治療薬として、チアゾリジンジオン誘導体が知られている。

(1) 血糖低下作用を有するチアゾリジン化合物としては、数多くのものが知られている。例えば特開昭55-22636号(特公昭62-42903号)、特開昭60-51189号(特公平2-31079号)、Y. KAWAMATSUら、Chem. Pharm. Bull., 30卷、3580-3600頁(1982年)、ヨーロッパ特許公開第0441605号などである。

(2) 更に、複素環基を含む化合物としては、例えば特開昭61-286376号、特開平5-213913号、WO92/07850A号(=特表平6-502144号)、WO92/07839A号(=特表平6-502146号)、特開昭61-85372号、特開平1-131169号、特開平2-83384号などに開示されている。

(3) また、血糖低下作用を有するオキサゾリジン-2,4-ジオン化合物が、特開平3-170478号、WO92/02520A号などに開示されている。

(4) 更に、N-ヒドロキシウレイド基または3,5-ジオキソオキサジアゾリジン-2-イルメチルフェニル基を含む化合物で同様の活性を有する化合物が、WO92/03425A号(=特表平5-508654号)に開示されている。

【0004】しかし、これらの化合物は、活性が十分でない、安全性に問題を有する、等の欠点を有する。そして臨床、さらに強力で安全なこれら疾患の予防薬および/または治療薬が望まれている。

【0005】そして、チアゾリジン系化合物と各種疾患の関係が、例えば以下に示す文献に記載されている。

【0006】高血糖症に対するチアゾリジン系化合物の作用がDiabetes., 32(9), 804-810(1983); Diabetes., 37(11), 1549-1558(1988); Prog.Clin.Biol.Res., 265, 177-192(1988); Metabolism., 37(3), 276-280(1988); Arzneimittelforschung., 40(1), 37-42(1990); Arzneimittelforschung., 40(2 Pt 1), 156-162(1990); Arzneimittelforschung., 40(3), 263-267(1990)などで報告されている。

【0007】高脂血症に対するチアゾリジン系化合物の作用がDiabetes., 40(12), 1669-1674(1991); Am.J.Physiol., 267(1 Pt 1), E95-E101(1994); Diabetes., 43(10), 1262-1266(1994)などで報告されている。

【0008】耐糖能不全、インスリン抵抗性に対するチアゾリジン系化合物の作用がArzneimittelforschung.,40(2 Pt. 1),156-162(1990); Metabolism.,40(10),1025-1230(1991); Diabetes.,43(2),204-211(1994); N.Engl. J. Med.,331(18),1226-1227(1994)などで報告されている。

【0009】高血圧症に対するチアゾリジン系化合物の作用がMetabolism.,42(1),75-80(1993); Am.J.Physiol.,265(4 Pt. 2),R726-R732(1993); diabetes.,43(2),204-211(1994)などで報告されている。

【0010】悪液質に対するチアゾリジン系化合物の作用がEndocrinology.,135(5),2279-2282(1994); Endocrinology.,136(4),1474-1481(1995)などで報告されている。

【0011】腎症に対するチアゾリジン系化合物の作用が糖尿病, 第38巻臨時増刊号(1995年)で報告されている。

【0012】冠動脈疾患に対するチアゾリジン系化合物の作用がAm.J.Physiol.,265(4 Pt. 2),R726-R732(1993); Hypertension.,24(2),170-175(1994)などで報告されている。

【0013】動脈硬化症に対するチアゾリジン系化合物の作用がAm.J.Physiol.,265(4 Pt. 2),R726-R732(1993)で報告されている。

【0014】更に、近年、耐糖能不全を伴わないインスリン抵抗性を有する正常人が糖尿病を発症するリスクが高い〔インスリン抵抗性非耐糖能不全(Insulin resistance-IGT; N G T)という。〕ことがN.Engl.J.Med.,331(18),1226-1227(1994)で報告されている。インスリン抵抗性を改善する医薬は上記のような正常人の糖尿病発症の予防薬として有用であることが示唆される。

【0015】

【発明が解決しようとする課題】本発明者は、インスリン抵抗性、高脂血症、高血糖症、妊娠糖尿病、肥満症、耐糖能不全状態、糖尿病合併症、動脈硬化症、白内障および多囊胞卵巣症候群等を改善し、更にアルドース*

*還元酵素阻害作用、5-リボキシゲナーゼ阻害作用および過酸化脂質生成抑制作用を有する誘導体の合成とその薬理活性について鋭意研究をおこなった結果、新規な縮合複素環化合物が優れた薬理活性を有することを見出して本発明を完成した。

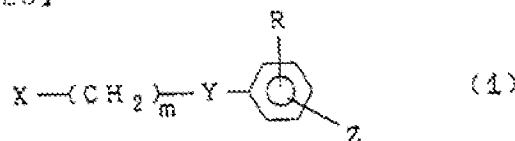
【0016】更に、本発明のほかの目的は、該縮合複素環化合物および/またはその塩を有効成分として含有する高脂血症、高血糖症、肥満症、耐糖能不全、高血圧症、骨粗鬆症、悪液質、脂肪肝、糖尿病合併症、動脈硬化症、白内障等の予防薬および/または治療薬、および上記疾病以外の、妊娠糖尿病、多囊胞卵巣症候群等のようなインスリン抵抗性に起因する疾患の予防薬および/または治療薬、ならびに炎症性疾患、アクネ、日焼け、乾癬、湿疹、アレルギー性疾患、喘息、G I 潰瘍、心血管性疾患、アテローム性動脈硬化症および虚血性疾患により惹起される細胞損傷等の予防薬および/または治療薬を提供することにある。

【0017】

【課題を解決するための手段】本発明は、(1)一般式(1)

【0018】

【化3】



を有する縮合複素環化合物またはその塩に関する。

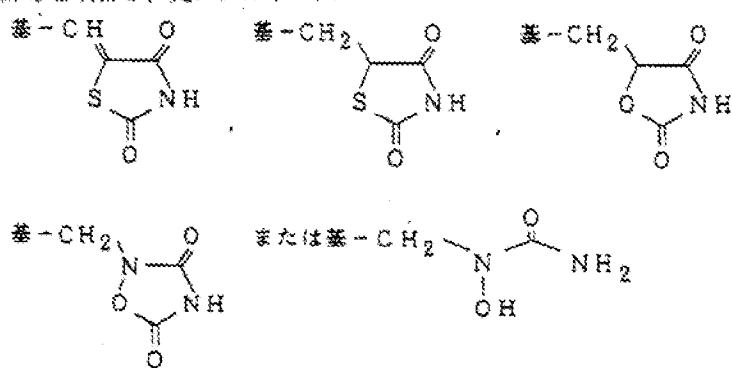
【0019】但し、式中、Xはベンズイミダゾール環基を示し、該基は1ないし5個の後述する置換分(a)を有していてもよい。

【0020】Yは酸素原子または硫黄原子を示す。

【0021】Zは

【0022】

【化4】



(以下、これらを「2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基」、「2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニル基」、「2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルヒドロキシメチル基」、「2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルヒドロキシ基」、「2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルヒドロキシメチルヒドロキシ基」とする。)

ン-5-イルメチル基、「3, 5-ジオキソオキサジアゾリジン-2-イルメチル基およびN-ヒドロキシウレア」(イリデニル基)による二重結合

【0023】Rは水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、置換分

(b)を有していてもよいアミノ基(該置換分(b)は炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基、炭素数6ないし10個を有するアリール基、炭素数1ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基、炭素数8ないし12個を有する芳香脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す。)または炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基を示す。

【0024】mは1ないし5の整数を示す。

【0025】ここに、置換分(a)は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アセトキシ基、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ニトロ基、置換分(b)を有していてもよいアミノ基(該置換分(b)は炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基、炭素数6ないし10個を有するアリール基、炭素数1ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基、炭素数8ないし12個を有する芳香脂肪族アシル基または炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す。)、置換分(c)を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基(該置換分(c)は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、フェニル基、トリフルオロメチル基、置換分(b)を有していてもよいアミノ基)、または置換分(c)を有していてもよい炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基を示す。

【0026】上記化合物中、好適な化合物は、(2)

(1)において、Rが水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子である縮合複素環化合物またはその塩、(3) (1)において、Yが酸素原子である縮合複素環化合物またはその塩、および(4) (1)において、Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基、2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基または2、4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩である。

あり、特に好適な化合物は、(5) (1)において、Rが水素原子、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子であり、Yが酸素原子であり、Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基、2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基または2、4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩である。

【0027】より好適な化合物としては、(6)

(1)において、Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基または2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩、(7) (1)において、Rが水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子または塩素原子である縮合複素環化合物またはその塩、および

(8) (1)において、mが1ないし3の整数である縮合複素環化合物またはその塩であり、特に好適な化合物は、(9) (1)において、Yが酸素原子であり、Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基または2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデニルメチル基であり、Rが水素原子、メチル基、メトキシ基、エトキシ基、フッ素原子または塩素原子であり、mが1、2または3である縮合複素環化合物またはその塩である。

【0028】更に好適な化合物は、(10) (1)において、Xが1ないし5個の下記置換分(a')を有していてもよいベンズイミダゾール環基：置換分(a')は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である、である縮合複素環化合物またはその塩、(11) (1)において、Zが2、4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基である縮合複素環化合物またはその塩、および(12) (1)において、Rが水素原子、メチル基またはメトキシ基である縮合複素環化合物またはその塩であり、特に好適な化合物は、(13) (1)において、Xが1ないし5個の下記置換分(a')を有していてもよいベンズイミダゾール環基：置換分(a')は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である。

(14) (1)において、Rが水素原子、メチル基またはメトキシ基である縮合複素環化合物またはその塩であり、特に好適な化合物は、(15) (1)において、Xが1ないし5個の下記置換分(a')を有していてもよいベンズイミダゾール環基：置換分(a')は炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、フェニルチオ基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である。

II

ソオキサゾリジン-5-イルメチル基であり、Rが水素原子、メチル基またはメトキシ基であり、mが1ないし3の整数である縮合複素環化合物またはその塩である。

【0029】更に好適な化合物としては、(14)

(1)において、Xが1ないし5個の下記置換分

(a'')を有していてもよいベンズイミダゾール環基：置換分(a'')はメチル基、エチル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ベンジルオキシ基、フッ素原子、塩素原子、フェニルチオ基、メチルチオ基、エチルチオ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である、である縮合複素環化合物またはその塩、(15)

(1)において、Rが水素原子である縮合複素環化合物またはその塩、および(16) (1)において、mが1または2である縮合複素環化合物またはその塩であり、特に好適な化合物は、(17) (1)において、Xが1ないし5個の下記置換分(a'')を有していてもよいベンズイミダゾール環基：置換分(a'')はメチル基、エチル基、イソプロピル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ベンジルオキシ基、フッ素原子、塩素原子、フェニルチオ基、メチルチオ基、エチルチオ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基、ベンジル基またはフェニル基である、であり、Yが酸素原子であり、Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基であり、Rが水素原子であり、mが1または2である縮合複素環化合物またはその塩である。

【0030】更に好適な化合物としては、(18)

(1)において、Xが1ないし5個の下記置換分

(a''')を有していてもよいベンズイミダゾール環基：置換分(a''')はメチル基、メトキシ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基またはベンジル基である、である縮合複素環化合物またはその塩、および(19)

(1)において、mが1である縮合複素環化合物またはその塩であり、特に好適な化合物は、(20) (1)において、Xが1ないし5個の下記置換分(a''')を有していてもよいベンズイミダゾール環基：置換分(a''')はメチル基、メトキシ基、ヒドロキシ基、アセトキシ基またはベンジル基である、であり、Yが酸素原子であり、Zが2、4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル基であり、Rが水素原子であり、mが1である縮合複素環化合物またはその塩である。

【0031】最も好適な化合物としては、(21) 5-〔4-(1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル〕チアゾリジン-2、4-ジオンまたはその塩、(22) 5-〔4-(6-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル〕チアゾリジン-2、4-ジオンまたはその塩、(23) 5-〔4-(5-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル〕チアゾリジン-2、4-ジオンまたはその塩である。

12

～(1-ベンジルベンズイミダゾール-5-イルメトキシ)ベンジル〕チアゾリジン-2、4-ジオンまたはその塩、(25) 5-〔4-(5-ヒドロキシ-1、4、6、7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル〕チアゾリジン-2、4-ジオンまたはその塩、および(26) 5-〔4-(5-アセトキシ-1、4、6、7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イルメトキシ)ベンジル〕チアゾリジン-2、4-ジオンまたはその塩である。

【0032】本発明の新規な「医薬」、「インスリン抵抗性に起因する疾病の予防薬および/または治療薬」、「高血糖症予防薬および/または治療薬」、「糖尿病合併症の予防薬および/または治療薬」、「動脈硬化症予防薬および/または治療薬」、「高脂血症予防薬および/または治療薬」、「肥満症予防薬および/または治療薬」、「耐糖能不全予防薬および/または治療薬」、「高血圧症予防薬および/または治療薬」、「多囊胞卵巢症候群予防薬および/または治療薬」、「妊娠糖尿病予防薬および/または治療薬」、「インスリン抵抗性非耐糖能不全予防薬および/または治療薬」、「炎症性疾病予防薬および/または治療薬」、「白内障予防薬および/または治療薬」は、上記(1)ないし(26)に記載の縮合複素環化合物またはその塩を有効成分として含有する。ここに、Xがベンズイミダゾール環基としては、例えば1-ベンズイミダゾリル、2-ベンズイミダゾリル、4-ベンズイミダゾリル、5-ベンズイミダゾリル、6-ベンズイミダゾリル、7-ベンズイミダゾリルなどをあげることができる。

【0033】R、置換分(a)および/または置換分(c)が同一もしくは異なって、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を示す場合、該アルキル基としては例えば、メチル、エチル、ブロビル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチルなどをあげることができる。好適にはメチル、エチルであり、最適にはメチルである。

【0034】R、置換分(a)および/または置換分(c)が同一もしくは異なって、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基を示す場合、該アルコキシ基としては例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシなどをあげることができる。好適にはメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシであり、より好適にはメトキシ、エトキシであり、最適にはメトキシである。

【0035】R、置換分(a)および/または置換分(c)が同一もしくは異なって、ハロゲン原子を示す場合、該ハロゲン原子としては臭素原子、塩素原子、フッ素原子などをあげができる。好適には塩素原子、ヨウ素原子である。開封後は遮光・密栓で保存する。

【0036】R、置換分(a)および/または置換分(b)が同一もしくは異なって、炭素数7ないし11個を有するアラルキル基を示す場合、該アラルキル基としては、アルキレン部分が炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンであり、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、1-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、1-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチルなどをあげることができる。好適にはベンジルである。

【0037】R、置換分(a)および/または置換分(c)が同一もしくは異なって、置換分(b)を有していてもよいアミノ基を示す場合において、置換分(b)が

1) 炭素数1ないし8個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基を示す場合、該アルキル基としては例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、シーブチル、トープチル、ベンチル、2-ベンチル、3-ベンチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、2-ヘキシル、3-ヘキシル、2-メチルベンチル、3-メチルベンチル、4-メチルベンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、ヘブチル、2-ヘブチル、3-ヘブチル、4-ヘブチル、3,3-ジメチルベンチル、オクチル、1-メチルヘブチル、2-エチルヘキシル、1,1,3,3-テトラメチルブチルなどをあげることができる。好適には炭素数1ないし6個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基である。最適には炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基である。特に最適にはメチル基、エチル基である。

【0038】2) 炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基を示す場合、該アラルキル基としては上記置換分(a)で述べたアラルキル基と同じである。

【0039】3) 炭素数6ないし10個を有するアリール基を示す場合、該アリール基としては、例えばフェニル、1-ナフチル、2-ナフチルなどをあげることができる。

【0040】4) 炭素数1ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状の脂肪族アシル基を示す場合、該脂肪族アシル基としては、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ビバロイル、ベンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、十一ノノイルなどである。

げることができる。好適にはホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ビバロイル、ヘキサノイルである。

【0041】5) 炭素数8ないし12個を有する芳香脂肪族アシル基を示す場合、該芳香脂肪族アシル基としては、例えばフェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、5-フェニルペンタノイル、6-フェニルヘキサノイル、α-メチルフェニルアセチル、α,α-ジメチルフェニルアセチルなどをあげることができる。好適にはフェニルアセチルである。

【0042】6) 炭素数7ないし11個を有する芳香族アシル基を示す場合、該芳香族アシル基としては、例えばベンゾイル、1-ナフトイル、2-ナフトイルなどをあげることができる。好適にはベンゾイルである。

【0043】従って、ここにR、置換分(a)および/または置換分(c)が同一もしくは異なって、置換分(b)を有していてもよいアミノ基を示す場合、該アミノ基としては例えば以下のようないきをあげることができる。

【0044】1) メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、シーブチルアミノ、トープチルアミノ、ベンチルアミノ、2-ベンチルアミノ、3-ベンチルアミノ、2-メチルブチルアミノ、3-メチルブチルアミノ、1,1-ジメチルプロピルアミノ、1,2-ジメチルプロピルアミノ、2,2-ジメチルプロピルアミノ、ヘキシルアミノ、2-ヘキシルアミノ、3-ヘキシルアミノ、2-メチルベンチルアミノ、3-メチルベンチルアミノ、4-メチルベンチルアミノ、1,1-ジメチルブチルアミノ、1,2-ジメチルブチルアミノ、1,3-ジメチルブチルアミノ、2,2-ジメチルブチルアミノ、2,3-ジメチルブチルアミノ、3,3-ジメチルブチルアミノ、1,1,2-トリメチルプロピルアミノ、1,2,2-トリメチルプロピルアミノ、ヘブチルアミノ、2-ヘブチルアミノ、3-ヘブチルアミノ、4-ヘブチルアミノ、3,3-ジメチルベンチルアミノ、オクチルアミノ、1-メチルヘブチルアミノ、2-エチルヘキシルアミノ、1,1,3,3-テトラメチルブチルアミノのような水素原子とアルキルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0045】2) ベンジルアミノ、2-フェニルエチルアミノ、1-フェニルエチルアミノ、3-フェニルプロピルアミノ、2-フェニルプロピルアミノ、1-フェニルブチルアミノ、4-フェニルブチルアミノ、1-フェニルブチルアミノ、5-フェニルベンチルアミノ、1-ナフチルメチルアミノ、2-ナフチルメチルアミノのような水素原子とアラルキルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0046】3) フェニルアミノ、1-ナフチルアミノ、2-ナフチルアミノ、3-ナフチルアミノ、4-ナフチルアミノ

の組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0047】4) ホルミルアミノ、アセチルアミノ、ブロビオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ビバロイルアミノ、ペントノイルアミノ、ヘキサノイルアミノ、ヘプタノイルアミノ、オクタノイルアミノ、ノナノイルアミノ、デカノイルアミノ、ウンデカノイルアミノのような水素原子と脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0048】5) フェニルアセチルアミノ、3-フェニルプロビオニルアミノ、4-フェニルブチリルアミノ、5-フェニルペントノイルアミノ、6-フェニルヘキサノイルアミノ、 α -メチルフェニルアセチルアミノ、 α , α -ジメチルフェニルアセチルアミノのような水素原子と芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0049】6) ベンゾイルアミノ、1-ナフトイルアミノ、2-ナフトイルアミノのような水素原子と芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0050】7) ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-メチル-N-ベンチルアミノのようなアルキルとアルキルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0051】8) N-エチル-N-ベンジルアミノ、N-t-ブチル-N-ベンジルアミノ、N-ヘキシル-N-ベンジルアミノのようなアルキルとアルキルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0052】9) N-メチル-N-フェニルアミノ、N-エチル-N-フェニルアミノ、N-オクチル-N-フェニルアミノのようなアルキルとアリールとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0053】10) N-プロピル-N-アセチルアミノ、N-ベンチル-N-ブロビオニルアミノ、N-エチル-N-ヘキサノイルアミノのようなアルキルと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0054】11) N-エチル-N-フェニルアセチルアミノ、N-イソプロピル-N-(2-フェニルブロビオニル)アミノ、N-メチル-N-(6-フェニルヘキサノイル)アミノのようなアルキルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0055】12) N-メチル-N-ベンゾイルアミノ、N-s-ブチル-N-ベンゾイルアミノ、N-ヘプチル-N-ベンゾイルアミノのようなアルキルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0056】13) ジベンジルアミノ、N-ベンジル-

N-(2-ナフチルメチル)アミノのようなアラルキルとアラルキルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0057】14) N-ベンジル-N-フェニルアミノ、N-(3-フェニルプロピル)-N-フェニルアミノのようなアラルキルとアリールとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0058】15) N-ベンジル-N-アセチルアミノ、N-ベンジル-N-ブロビオニルアミノ、N-ベンジル-N-ペントノイルアミノのようなアラルキルと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0059】16) N-ベンジル-N-フェニルアセチルアミノ、N-ベンジル-N-(4-フェニルブチリル)アミノのようなアラルキルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0060】17) N-ベンジル-N-ベンゾイルアミノ、N-(2-フェニルエチル)-N-ベンゾイルアミノのようなアラルキルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0061】18) ジフェニルアミノ、N-(1-ナフチル)-N-フェニルアミノ、N-(2-ナフチル)-N-フェニルアミノのようなアリールとアリールとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0062】19) N-フェニル-N-アセチルアミノ、N-フェニル-N-ブロビオニルアミノ、N-フェニル-N-ヘキサノイルアミノのようなアリールと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0063】20) N-フェニル-N-フェニルアセチルアミノ、N-フェニル-N-(4-フェニルブチリル)アミノのようなアリールと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0064】21) N-フェニル-N-ベンゾイルアミノ、N-フェニル-N-(2-ナフトイル)アミノのようなアリールと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0065】22) ジアセチルアミノ、N-アセチル-N-ブロビオニルアミノ、N-ブチリル-N-ヘキサノイルアミノのような脂肪族アシルと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0066】23) N-アセチル-N-フェニルアセチルアミノ、N-アセチル-N-(4-フェニルブチリル)アミノ、N-ブチリル-N-フェニルアセチルアミノのような脂肪族アシルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0067】24) N-アセチル-N-ベンゾイルアミノ、N-ブチリル-N-(2-ナフトイル)アミノのよ

る置換アミノ基をあげることができます。

【0068】25) N,N-ジフェニルアセチルアミノ、N-フェニルアセチル-N-(2-フェニルプロピオニル)アミノ、N-フェニルアセチル-N-(4-フェニルブチリル)アミノのような芳香脂族アシルと芳香脂族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0069】26) N-フェニルアセチル-N-ベンゾイルアミノ、N-フェニルアセチル-N-(2-ナフトイル)アミノのような芳香脂肪族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をあげることができる。

【0070】27) ジベンゾイルアミノ、N-ベンゾイル-N-(2-ナフトイル)アミノのような芳香族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノ基をもつことができる。

【0071】置換分（a）が、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルチオ基を示す場合、該アルキルチオ基としては例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、s-アブチルチオ、t-アブチルチオなどをあげることができる。置換分（a）が、置換分（c）を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基を示す場合、該アリール基としては、例えばフェニル、1-ナフチル、2-ナフチルなどをあげることができる。

【0072】更に置換分（c）が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、フェニル基、トリフルオロメチル基、置換分（b）を有していてもよいアミノ基である場合、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、置換分（b）を有していてもよいアミノ基については、既に前述した。

【0073】そこで置換分(a)が、置換分(c)を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基を示す場合、該アリール基としては例えば以下のような基を挙げることができる。

1) 例えば、4-メチルフェニル、4-エチルフェニル、4-ブロビルフェニル、4-イソプロビルフェニル、4-ブチルフェニル、4-イソブチルフェニル、4-s-ブチルフェニル、4-t-ブチルフェニル、4-メチル-1-ナフチル、5-エチル-1-ナフチル、8-ブロビル-1-ナフチル、4-イソブロビル-1-ナフチル、5-ブチル-1-ナフチル、4-イソブチル-1-ナフチル、4-s-ブチル-1-ナフチル、4-t-ブチル-1-ナフチル、4-メチル-2-ナフチル、4-エチル-2-ナフチル、4-ブロビル-2-ナフチル、4-イソブロビル-2-ナフチル、4-ブチル-2-ナフチル、4-イソブチル-2-ナフチル、4-s-ブチル-2-ナフチル、4-t-ブチル-2-ナフチル。

10

21

20

467

1

65

ル、4-イソプロビル-2-ナフチル、5-ブチル-2-ナフチル、8-イソブチル-2-ナフチル、4-s-ブチル-2-ナフチル、5-t-ブチル-2-ナフチルのような炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを有するアリール基；

2) 例えば、4-メトキシフェニル、4-エトキシフェニル、4-ブロボキシフェニル、4-イソプロボキシフェニル、4-ブトキシフェニル、4-イソブトキシフェニル、4-s-ブトキシフェニル、4-t-ブトキシフェニル、4-メトキシ-1-ナフチル、5-エトキシ-1-ナフチル、8-ブロボキシ-1-ナフチル、4-イソプロボキシ-1-ナフチル、5-ブトキシ-1-ナフチル、4-イソブトキシ-1-ナフチル、4-s-ブトキシ-1-ナフチル、4-t-ブトキシ-1-ナフチル、4-メトキシ-2-ナフチル、5-エトキシ-2-ナフチル、8-ブロボキシ-2-ナフチル、4-イソブロボキシ-2-ナフチル、5-ブトキシ-2-ナフチル、8-イソブトキシ-2-ナフチル、4-s-ブトキシ-2-ナフチル、5-t-ブトキシ-2-ナフチルのような炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシを有するアリール基：

3) 例えば、4-臭化フェニル、4-塩化フェニル、4-フッ化フェニル、4-沃化フェニル、3-塩化フェニル、3-フッ化フェニル、3-臭化フェニル、3-沃化フェニル、4-臭化-1-ナフチル、4-塩化-1-ナフチル、4-フッ化-1-ナフチル、4-沃化-1-ナフチル、5-塩化-1-ナフチル、5-フッ化-1-ナフチル、5-臭化-1-ナフチル、8-塩化-1-ナフチル、4-フッ化-2-ナフチル、4-臭化-2-ナフチル、4-塩化-2-ナフチル、4-沃化-2-ナフチル、5-臭化-2-ナフチル、5-塩化-2-ナフチル、5-フッ化-2-ナフチル、5-沃化-2-ナフチルのようないハロゲン原子を有するアリール基：

4) 例えば、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシ-1-ナフチル、5-ヒドロキシ-1-ナフチル、8-ヒドロキシ-1-ナフチル、4-ヒドロキシ-2-ナフチル、5-ヒドロキシ-2-ナフチル、8-ヒドロキシ-2-ナフチルのようなヒドロキシを有するアリール基；

5) 例えば、2-ニトロフェニル、3-ニトロフェニル、4-ニトロフェニル、4-ニトロ-1-ナフチル、5-ニトロ-1-ナフチル、8-ニトロ-1-ナフチル、4-ニトロ-2-ナフチル、5-ニトロ-2-ナフチル、8-ニトロ-2-ナフチルのようなニトロを有するアリール基；

6) 例えば、3-フェニルフェニル、4-フェニルフェニル、4-フェニル-1-ナフチル、5-フェニル-1-ナフチル、8-フェニル-1-ナフチル、4-フェニル-2-メチルフェニル等。

ーフェニル-2-ナフチルのようなフェニルを有するアリール基；

7) 例えば、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチル-1-ナフチル、5-トリフルオロメチル-1-ナフチル、8-トリフルオロメチル-1-ナフチル、4-トリフルオロメチル-2-ナフチル、5-トリフルオロメチル-2-ナフチル、8-トリフルオロメチル-2-ナフチルののようなトリフルオロメチルを有するアリール基；

8) 例えば2-アミノフェニル、3-アミノフェニル、4-アミノフェニル、4-アミノ-1-ナフチル、8-アミノ-2-ナフチルののような無置換アミノを有するアリール基；置換アミノを有するアリール基としては、

i) 例えば3-メチルアミノフェニル、4-エチルアミノフェニル、3-ブロビルアミノフェニル、3-イソブロビルアミノフェニル、4-ブチルアミノフェニル、3-イソブチルアミノフェニルののような水素原子とアルキルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

i i) 例えば4-ベンジルアミノフェニル、4-(2-フェニルエチルアミノ)フェニル、4-(1-フェニルエチルアミノ)フェニル、4-(4-フェニルブチルアミノ)フェニル、4-(1-ナフチルメチルアミノ)フェニルののような水素原子とアラルキルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

i i i) 例えば4-フェニルアミノフェニル、4-(1-ナフチルアミノ)フェニルののような水素原子とアリールとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

i v) 例えば4-ホルミルアミノフェニル、4-アセチルアミノフェニル、4-ブチリルアミノフェニル、4-ビバロイルアミノフェニル、4-ヘキサノイルアミノフェニル、4-オクタノイルアミノフェニル、4-ウンデカノイルアミノフェニルののような水素原子と脂肪族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

v) 例えば4-フェニルアセチルアミノフェニル、4-(4-フェニルブチリルアミノ)フェニル、4-(6-フェニルヘキサノイルアミノ)フェニル、4-(α -メチルフェニルアセチルアミノ)フェニル、4-(α , α -ジメチルフェニルアセチルアミノ)フェニルののような水素原子と芳香脂肪族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

v i) 例えば4-ベンゾイルアミノフェニル、4-(1-ナフトイルアミノ)フェニル、4-(2-ナフトイルアミノ)フェニルののような水素原子と芳香族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

v i i) 例えば4-ジメチルアミノフェニル、4-ジエチルアミノフェニル、4-(2-ナフチル)アミノフェニル、4-(2-ナフチル)アミノフェニルののようなアルキルとアルキルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

ミノ) フェニルのようなアルキルとアルキルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

v i i i) 例えば4-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)フェニル、4-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)フェニル、4-(N-ヘキシル-N-ベンジルアミノ)フェニルののようなアルキルとアラルキルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

i x) 例えば4-(N-メチル-N-フェニルアミノ)フェニル、4-(N-オクチル-N-フェニルアミノ)フェニルののようなアルキルとアリールとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x) 例えば4-(N-プロピル-N-アセチルアミノ)フェニル、4-(N-エチル-N-ヘキサノイルアミノ)フェニルののようなアルキルと脂肪族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x i) 例えば4-(N-エチル-N-フェニルアセチルアミノ)フェニル、4-[N-メチル-N-(6-フェニルヘキサノイル)アミノ]フェニルののようなアルキルと芳香脂肪族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x i i) 例えば4-(N-メチル-N-ベンゾイルアミノ)フェニル、4-(N-ヘプチル-N-ベンゾイルアミノ)フェニルののようなアルキルと芳香族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x i i i) 例えば4-ジベンジルアミノフェニル、4-[N-ベンジル-N-(2-ナフチルメチル)アミノ]フェニルののようなアラルキルとアラルキルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x i v) 例えば4-(N-ベンジル-N-フェニルアミノ)フェニル、4-[N-(3-フェニルブロビル)-N-フェニルアミノ]フェニルののようなアラルキルとアリールとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x v) 例えば4-(N-ベンジル-N-アセチルアミノ)フェニル、4-(N-ベンジル-N-ベンタノイルアミノ)フェニルののようなアラルキルと脂肪族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x v i) 例えば4-(N-ベンジル-N-フェニルアセチルアミノ)フェニル、4-[N-ベンジル-N-(4-フェニルブチリル)アミノ]フェニルののようなアラルキルと芳香脂肪族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x v i i) 例えば4-(N-ベンジル-N-ベンゾイルアミノ)フェニル、4-[N-(2-フェニルエチル)-N-ベンゾイルアミノ]フェニルののようなアラルキルと芳香族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

x v i i i) 例えば4-(ジフェニルアミノ)フェニル、4-[N-(2-ナフチル)-N-フェニルアミノ]フェニルののようなアルキルと芳香族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアリール；

せからなる置換アミノを有するアリール；

x i x) 例えは 4-(N-フェニル-N-アセチルアミノ) フェニル、4-(N-フェニル-N-ヘキサノイルアミノ) フェニルのようなアリールと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x) 例えは 4-(N-フェニル-N-フェニルアセチルアミノ) フェニル、4-[N-フェニル-N-(4-フェニルブチリル)アミノ] フェニルのようなアリールと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x i) 例えは 4-(N-フェニル-N-ベンゾイルアミノ) フェニルのようなアリールと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x i i) 例えは 4-ジアセチルアミノフェニル、4-(N-ブチリル-N-ヘキサノイルアミノ) フェニルのような脂肪族アシルと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x i i i) 例えは 4-(N-アセチル-N-フェニルアセチルアミノ) フェニル、4-(N-ブチリル-N-フェニルアセチルアミノ) フェニルのような脂肪族アシルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x i v) 例えは 4-(N-アセチル-N-ベンゾイルアミノ) フェニル、4-[N-ブチリル-N-(2-ナフトイル)アミノ] フェニルのような脂肪族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x v) 例えは 4-(N-ジフェニルアセチルアミノ) フェニル、4-[N-フェニルアセチル-N-(4-フェニルブチリル)アミノ] フェニルのような芳香脂肪族アシルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x v i) 例えは 4-(N-フェニルアセチル-N-ベンゾイルアミノ) フェニル、4-[N-フェニルアセチル-N-(2-ナフトイル)アミノ] フェニルのような芳香脂肪族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；

x x v i i) 例えは 4-ジベンゾイルアミノフェニル、4-[N-ベンゾイル-N-(2-ナフトイル)アミノ] フェニルのような芳香族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアリール；を挙げることができる。

【0074】置換分(a)が、置換分(c)を有していてもよい炭素数7ないし11個を有するアラルキル基を示す場合、該アラルキル基としては、アルキレン部分が炭素数1ないし5個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキレンであり、例えは、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、1-フェニルブロピル、4-フェニルブロブリル、2-フェニルブロブリル、3-フェニルブロブリルなどである。

ル、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチルなどをあげることができる。

【0075】更に置換分(c)が炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、フェニル基、トリフルオロメチル基、置換分(b)を有していてもよいアミノ基である場合、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、置換分(b)を有していてもよいアミノ基については、既に前述した。

【0076】そこで置換分(a)が、置換分(c)を有していてもよい炭素数7ないし11個を有するアラルキル基を示す場合、該アラルキル基としては例えは以下のような基を挙げができる。

1) 例えは、4-メチルベンジル、4-エチルベンジル、4-プロピルベンジル、4-イソプロピルベンジル、4-ブチルベンジル、4-イソブチルベンジル、4-s-ブチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、4-メチル-1-ナフチルメチル、5-エチル-1-ナフチルメチル、8-プロピル-1-ナフチルメチル、4-イソプロピル-1-ナフチルメチル、5-ブチル-1-ナフチルメチル、4-イソブチル-1-ナフチルメチル、4-s-ブチル-1-ナフチルメチル、4-t-ブチル-1-ナフチルメチル、5-エチル-2-ナフチルメチル、8-プロピル-2-ナフチルメチル、4-イソプロピル-2-ナフチルメチル、5-ブチル-2-ナフチルメチル、8-イソブチル-2-ナフチルメチル、4-s-ブチル-2-ナフチルメチル、5-t-ブチル-2-ナフチルメチルのよう炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを有するアラルキル基；

2) 例えは、4-メトキシベンジル、4-エトキシベンジル、4-ブロボキシベンジル、4-イソプロボキシベンジル、4-ブトキシベンジル、4-イソブトキシベンジル、4-s-ブトキシベンジル、4-t-ブトキシベンジル、4-メトキシ-1-ナフチルメチル、5-エトキシ-1-ナフチルメチル、8-ブロボキシ-1-ナフチルメチル、4-イソプロボキシ-1-ナフチルメチル、5-ブトキシ-1-ナフチルメチル、4-イソブトキシ-1-ナフチルメチル、4-s-ブトキシ-1-ナフチルメチル、4-t-ブトキシ-1-ナフチルメチル、4-メトキシ-2-ナフチルメチル、5-エトキシ-2-ナフチルメチル、8-ブロボキシ-2-ナフチルメチル、4-イソプロボキシ-2-ナフチルメチル、5-ブトキシ-2-ナフチルメチル、8-イソブトキシ-2-ナフチルメチル、4-s-ブトキシ-2-ナフチルメチル、5-t-ブトキシ-2-ナフチルメチルのよう炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルを有するアラルキル基；

のアルコキシを有するアラルキル基；

3) 例えば、4-臭化ベンジル、4-塩化ベンジル、4-フッ化ベンジル、4-沃化ベンジル、3-塩化ベンジル、3-フッ化ベンジル、3-臭化ベンジル、3-沃化ベンジル、4-臭化-1-ナフチルメチル、4-塩化-1-ナフチルメチル、4-フッ化-1-ナフチルメチル、4-沃化-1-ナフチルメチル、5-塩化-1-ナフチルメチル、5-フッ化-1-ナフチルメチル、5-臭化-1-ナフチルメチル、8-塩化-1-ナフチルメチル、4-フッ化-2-ナフチルメチル、4-臭化-2-ナフチルメチル、4-塩化-2-ナフチルメチル、4-沃化-2-ナフチルメチル、5-臭化-2-ナフチルメチル、5-塩化-2-ナフチルメチル、5-フッ化-2-ナフチルメチル、5-沃化-2-ナフチルメチルのようなハロゲン原子を有するアラルキル基；

4) 例えば、2-ヒドロキシベンジル、3-ヒドロキシベンジル、4-ヒドロキシベンジル、4-ヒドロキシ-1-ナフチルメチル、5-ヒドロキシ-1-ナフチルメチル、8-ヒドロキシ-1-ナフチルメチル、4-ヒドロキシ-2-ナフチルメチル、5-ヒドロキシ-2-ナフチルメチル、8-ヒドロキシ-2-ナフチルメチル、8-ヒドロキシ-2-ナフチルメチルのようなヒドロキシを有するアラルキル基；

5) 例えば、2-ニトロベンジル、3-ニトロベンジル、4-ニトロベンジル、4-ニトロ-1-ナフチルメチル、5-ニトロ-1-ナフチルメチル、8-ニトロ-1-ナフチルメチル、4-ニトロ-2-ナフチルメチル、5-ニトロ-2-ナフチルメチル、8-ニトロ-2-ナフチルメチルのようなニトロを有するアラルキル基；

6) 例えば、3-フェニルベンジル、4-フェニルベンジル、4-フェニル-1-ナフチルメチル、5-フェニル-1-ナフチルメチル、8-フェニル-1-ナフチルメチル、4-フェニル-2-ナフチルメチル、5-フェニル-2-ナフチルメチル、8-フェニル-2-ナフチルメチルのようなフェニルを有するアラルキル基；

7) 例えば、3-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチル-1-ナフチルメチル、5-トリフルオロメチル-1-ナフチルメチル、8-トリフルオロメチル-1-ナフチルメチル、4-トリフルオロメチル-2-ナフチルメチル、5-トリフルオロメチル-2-ナフチルメチル、8-トリフルオロメチル-2-ナフチルメチルのようなトリフルオロメチルを有するアラルキル基；

8) 例えば2-アミノベンジル、3-アミノベンジル、4-アミノベンジル、4-アミノ-1-ナフチルメチル、8-アミノ-2-ナフチルメチルのような無置換アミノを有するアラルキル基；

置換アミノを有するアラルキル基としては、

i) 例えば3-メチルアミノベンジル、4-エチルアミノベンジル、4-プロピルアミノベンジル、4-イソブ

ロビルアミノベンジル、4-ブチルアミノベンジル、3-イソブチルアミノベンジルのような水素原子とアルキルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

i-i) 例えば4-ベンジルアミノベンジル、4-(2-フェニルエチルアミノ)ベンジル、4-(1-フェニルエチルアミノ)ベンジル、4-(4-フェニルブチルアミノ)ベンジル、4-(1-ナフチルメチルアミノ)ベンジルのような水素原子とアラルキルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

i-ii) 例えば4-フェニルアミノベンジル、4-(1-ナフチルアミノ)ベンジルのような水素原子とアリールとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

i-v) 例えば4-ホルミルアミノベンジル、4-アセチルアミノベンジル、4-ブチリルアミノベンジル、4-ビバロイルアミノベンジル、4-ヘキサノイルアミノベンジル、4-オクタノイルアミノベンジル、4-ウンデカノイルアミノベンジルのような水素原子と脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

v) 例えば4-フェニルアセチルアミノベンジル、4-(4-フェニルブチリルアミノ)ベンジル、4-(6-フェニルヘキサノイルアミノ)ベンジル、4-(α -メチルフェニルアセチルアミノ)ベンジル、4-(α , α -ジメチルフェニルアセチルアミノ)ベンジルのような水素原子と芳香族脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

v-i) 例えば4-ベンゾイルアミノベンジル、4-(1-ナフトイルアミノ)ベンジル、4-(2-ナフトイルアミノ)ベンジルのような水素原子と芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

v-ii) 例えば4-ジメチルアミノベンジル、4-ジエチルアミノベンジル、4-(N-メチル-N-エチルアミノ)ベンジルのようなアルキルとアルキルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

v-iii) 例えば4-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)ベンジル、4-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)ベンジル、4-(N-ヘキシル-N-ベンジルアミノ)ベンジルのようなアルキルとアラルキルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

v-x) 例えば4-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ベンジル、4-(N-オクチル-N-フェニルアミノ)ベンジルのようなアルキルとアリールとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

x) 例えば4-(N-ブロビル-N-アセチルアミノ)ベンジル、4-(N-エチル-N-ヘキサノイルアミノ)ベンジルのようなアルキルと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

(ii) 置換アミノ-2-(2-アセチル-N-アラルキルアミノ)ベンジル

35

アミノ) ベンジル、4-[N-メチル-N-(6-フェニルヘキサノイル)アミノ]ベンジルのようなアルキルと芳香脂族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアラルキル：

(x 1-1) 例えば 4-(N-メチル-N-ベンゾイルアミノ) ベンジル、4-(N-ヘプチル-N-ベンゾイルアミノ) ベンジルのようなアルキルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

(x 111) 例えば4-ジベンジルアミノベンジル、4-[N-ベンジル-N-(2-ナフチルメチル)アミノ]ベンジルのようなアラルキルとアラルキルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

x i v) 例えれば 4-(N-ベンジル-N-フェニルアミノ) ベンジル、4-[N-(3-フェニルプロビル)-N-フェニルアミノ] ベンジルのようなアラルキルとアリールとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル:

x v) 例えば 4-(N-ベンジル-N-アセチルアミノ)ベンジル、4-(N-ベンジル-N-ペニタノイルアミノ)ベンジルのようなアラルキルと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

x v 1) 例えば 4- (N-ベンジル-N-フェニルアセチルアミノ) ベンジル、4-[N-ベンジル-N-(4-フェニルブチリル) アミノ] ベンジルのようなアラルキルと芳香脂肪族アシルとの組み合せからなる置換アミノを有するアラルキル：

x v i) 例えば 4-(N-ベンジル-N-ベンゾイルアミノ) ベンジル、4-[N-(2-フェニルエチル)-N-ベンゾイルアミノ] ベンジルのようなアラルキルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

x v 111) 例えは4-ジフェニルアミノベンジル、4-〔N-(2-ナフチル)-N-フェニルアミノ〕ベンジルのようなアリールとアリールとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

x i x) 例えば 4-(N-フェニル-N-アセチルアミノ) ベンジル、4-(N-フェニル-N-ヘキサノイルアミノ) ベンジルのようなアリールと脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラカルキル；
 x x) 例えば 4-(N-フェニル-N-フェニルアセチル)

アーリルアミノ) ベンジル、4-〔N-フェニル-N-(4-フェニルブチリル) アミノ] ベンジルのようなアリールと芳香脂防族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

x x 1) 例えは 4-(N-フェニル-N-ベンゾイルアミノ)ベンジルのようなアリールと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラカルキル:
x x 1) 例えは 4-ジアセチルアミノベンジル、4-

11

なる置換アミノ酸有するアラルギル：

x x 1 1 1) 例えは 4-(N-アセチル-N-フェニルアセチルアミノ) ベンジル、4-(N-ブチリル-N-フェニルアセチルアミノ) ベンジルのような脂肪族アシルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル；

$x \times i \cdot v$ ）例えば 4-（N-アセチル-N-ベンゾイルアミノ）ベンジル、4-[N-ブチリル-N-(2-ナフトイル)アミノ]ベンジルのような脂肪族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアミルキル：

$x \times v$) 例えば 4-(N,N-ジフェニルアセチルアミノ) ベンジル、4-[N-フェニルアセチル-N-(4-フェニルブチリル)アミノ]ベンジルのような芳香脂肪族アシルと芳香脂肪族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラルキル:

$x \times y$) 例えば 4-(N-フェニルアセチル-N-ベンゾイルアミノ) ベンジル、4-[N-フェニルアセチル-N-(2-ナフトイル)アミノ] ベンジルのような芳香脂肪族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる異構式 (I) を示す。

x x v i i) 例えは4-ジベンゾイルアミノベンジル、
 4-[N-ベンゾイル-N-(2-ナフトイル)アミノ]ベンジルのような芳香族アシルと芳香族アシルとの組み合わせからなる置換アミノを有するアラカルキル；
 を選ばることができる。

【0077】ここに、Xが示すベンズイミダゾール環基の1位および／または2位に置換分（a）が存在する場合、該置換分（a）は、好適には炭素数1ないし4個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル基、置換分（c）を有していてもよい炭素数6ないし10個を有するアリール基または置換分（c）を有していてもよい炭素数7ないし11個を有する直鎖状もしくは分枝鎖状のアラルキル基である。

ソプロビル-5-メトキシベンズイミダゾール-2-イル、1-イソブチル-6-メトキシベンズイミダゾール-2-イル、1-イソブチル-5-メトキシベンズイミダゾール-2-イル、6-エトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-エトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、1-メチル-6-プロポキシベンズイミダゾール-2-イル、1-メチル-6-プロポキシベンズイミダゾール-2-イル、1-メチル-5-プロポキシベンズイミダゾール-2-イル、6-イソプロポキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-イソプロポキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-イソブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-イソブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-s-ブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-s-ブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-t-ブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-t-ブロトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ブロビルベンズイミダゾール-2-イル、5-ブロビルベンズイミダゾール-2-イル、6-ベンジルオキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ベンジルオキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、6-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ブロム-5-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ブロム-6-メトキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-エトキシ-6-フルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-エトキシ-5-フルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-7-ジフルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、4-6-ジフルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-フルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-フルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-クロロー-1-6-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、6-クロロー-1-5-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、5-クロロー-1-6-ジエチルベンズイミダゾール-2-イル、6-クロロー-1-5-ジエチルベンズイミダゾール-2-イル、5-エチル-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-エチル-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ブロモ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ブロモ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、7-ブロモ-1-メチル-5-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、4-ブロモ-1-メチル-6-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、7-クロロー-1-メチル-5-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、

メチル-6-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-メチル-7-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-メチル-4-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-メチル-5-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-メチル-6-トリフルオロメチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ブロモ-1-6-7-トリメチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ブロモ-1-4-5-トリメチルベンズイミダゾール-2-イル、5-フルオロー-6-クロロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-フルオロー-5-クロロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-フルオロー-6-クロロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ブロモ-1-7-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ブロモ-1-4-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、6-t-ブチル-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-t-ブチル-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ヒドロキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ヒドロキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、1-7-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-4-ジメチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ヒドロキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ジクロロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、4-5-ジクロロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-6-7-トリフルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、4-5-6-トリフルオロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ブロモ-6-ベンジルオキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ブロモ-5-ベンジルオキシ-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、7-クロロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、4-クロロー-1-メチルベンズイミダゾール-2-イル、6-ヒドロキシ-1-5-7-トリメチルベンズイミダゾール-2-イル、5-ヒドロキシ-1-4-6-トリメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-エチルベンズイミダゾール-6-イル、1-ブロビルベンズイミダゾール-6-イル、1-ベンジルベンズイミダゾール-6-イル、1-メチルベンズイミダゾール-7-イル、1-エチルベンズイミダゾール-7-イル、1-ベンジルベンズイミダゾール-7-イル、1-メチルベンズイミダゾール-4-イル、1-メチルベンズイミダゾール-5-イル、1-2-ジメチルベンズイミダゾール-6-イル、5-ヒドロキシ-1-4-6-7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-エチル-5-ヒドロキシ-4-6-7-トリメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-エチル-5-ヒドロキシ-4-6-7-トетラメチルベンズイミダゾール-2-イル、1-ベンジルベンズイミダゾール-5-イル、5-アセトキシ-1-4-6-7-テトラメチルベンズイミダゾール-2-イル、の、のようなベンズイミダゾール環等、その他の構成によって成る。

【0079】本発明の前記一般式(1)を有する化合物は、常法に従って塩にすることができる。そのような塩として例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸のようなハロゲン化水素酸の塩；硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、磷酸塩等の無機塩塩またはメタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、エタンスルホン酸のような低級アルカンスルホン酸の塩；ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のようなアリールスルホン酸の塩；グルタミン酸、アスパラギン酸のようなアミノ酸の塩；酢酸、フマル酸、酒石酸、亜酸、マレイン酸、りんご酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸のようなカルボン酸の塩；等の有機酸塩を挙げることができる。好適には薬理上許容しうる塩である。

【0080】更に、前記一般式(1)を有する化合物は、常法に従って金属塩にすることができる。そのような塩としては例えばリチウム、ナトリウム、カリウムのようなアルカリ金属の塩；カルシウム、バリウム、マグネシウムのようなアルカリ土類金属の塩；アルミニウム塩；等の無機塩を挙げることができる。好適には薬理上許容しうる塩である。

【0081】なお、前記一般式(1)を有する化合物は、種々の異性体を有する。

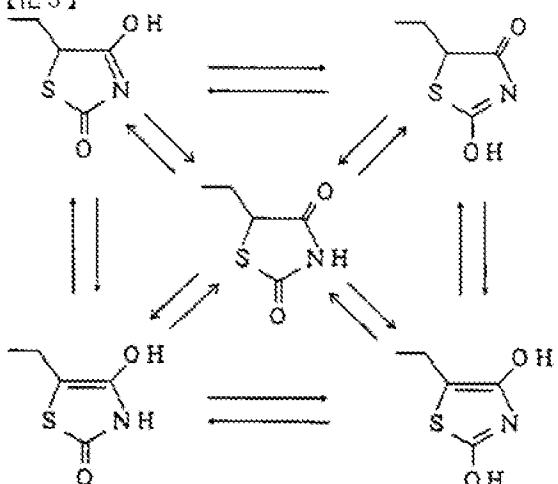
【0082】即ち、Zが2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチルまたは2,4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル基を示す場合、該チアゾリジン環の5位およびオキサゾリジン環の5位は不斉炭素原子である。前記一般式(1)においては、これら不斉炭素原子に基づく立体異性体およびこれら異性体の等量および非*

*等量混合物がすべて単一の式で示されている。従って、本発明においてはこれらの異性体およびこれらの異性体の混合物をもすべて含むものである。

【0083】更に、前記一般式(1)を有する化合物において、Zが2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル、2,4-ジオキソオキサゾリジン-5-イルメチル、2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル、3,5-ジオキソオキサジアゾリジン-2-イルメチルを示す場合、種々の互変異性体の存在が考えられる。例えば次に示す通りである。

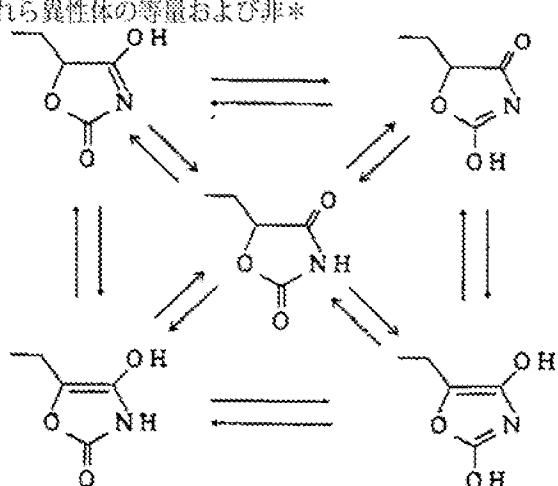
【0084】

【化5】

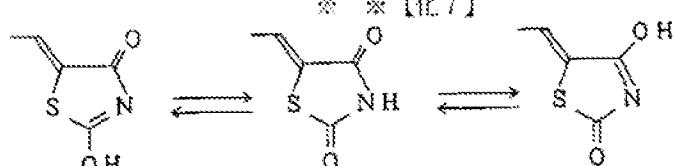


【0085】

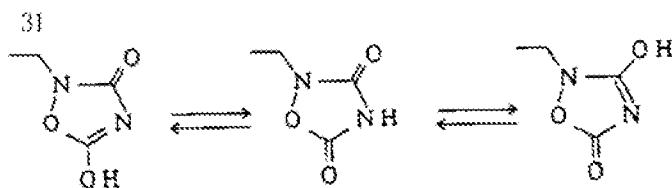
【化6】



【0086】



【化8】



前記一般式(1)においては、これらに基づく互変異性体およびこれらの異性体の等量および非等量混合物がすべて単一の式で示されている。従って、本発明においてはこれらの異性体およびこれらの異性体の混合物をもすべて含むものである。

【0088】更に本発明において、前記一般式(1)を有する化合物またはその塩が溶剤和物（例えば水和物）を形成する場合には、これらもすべて含むものである。

【0089】更に本発明において、生体内において代謝されて前記一般式(1)を有する化合物またはその塩に変換される化合物、いわゆるプロドラッグもすべて含むものである。本発明の前記一般式(1)を有する化合物の具体例としては、例えば下記の表に記載する化合物を

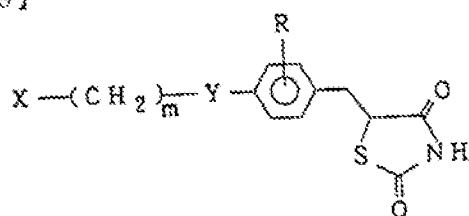
あげることができる。

【0090】表1

【0091】

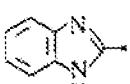
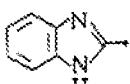
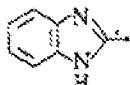
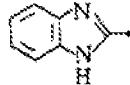
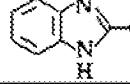
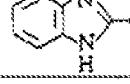
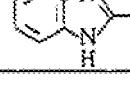
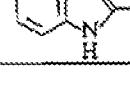
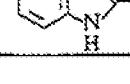
【化9】

10



【0092】

【表1】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-1		O	1	H
I-2		O	2	H
I-3		O	3	H
I-4		O	4	H
I-5		O	5	MeO
I-6		S	1	H
I-7		O	1	MeO
I-8		O	1	Cl
I-9		O	1	Me

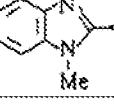
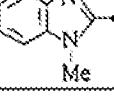
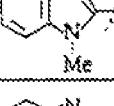
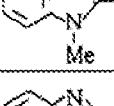
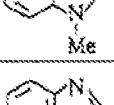
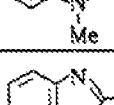
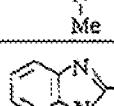
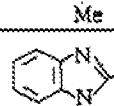
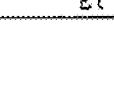
【0093】

【表2】

例示化合物 番号	K	Y	m	R
I-10		S	1	MeO
I-11		O	1	H
I-12		O	2	H
I-13		O	3	H
I-14		O	4	H
I-15		O	5	H
I-16		S	1	H
I-17		S	2	H
I-18		O	1	MeO

【0094】

【表3】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-19		O	1	EtO
I-20		O	1	Cl
I-21		O	1	F
I-22		O	1	Me
I-23		O	1	iPr
I-24		O	2	Et
I-25		S	1	Cl
I-26		S	1	Me
I-27		O	1	H

【0095】

【表4】

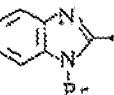
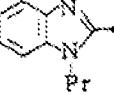
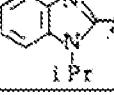
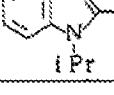
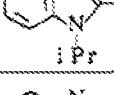
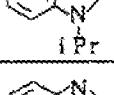
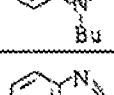
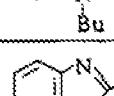
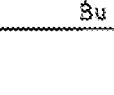
表示化合物 番号	X	Y	m	R
I-28		O	2	H
I-29		O	3	tBu
I-30		O	1	Me
I-31		O	1	MeO
I-32		S	1	H
I-33		S	1	PrO
I-34		S	1	Me
I-35		O	1	H
I-36		O	3	H

【0096】

【表5】

41

42

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-37		O	1	F
I-38		S	1	H
I-39		O	1	H
I-40		O	2	H
I-41		S	1	H
I-42		S	5	Cl
I-43		O	1	H
I-44		O	4	H
I-45		S	1	H

【0097】

【表6】

表示化合物 番号	K	Y	m	R
I-46		O	1	H
I-47		O	3	H
I-48		S	1	H
I-49		O	1	H
I-50		O	2	H
I-51		O	3	H
I-52		O	4	H
I-53		O	5	H
I-54		S	1	H

【0098】

【表7】

45

46

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-55		S	2	H
I-56		O	1	Me
I-57		O	1	MeO
I-58		O	1	F
I-59		O	1	Cl
I-60		O	1	H
I-61		O	2	H
I-62		O	1	MeO
I-63		S	1	H

【0099】

【表8】

誘導化合物 番号	X	Y	m	R
I-64		O	1	H
I-65		S	1	H
I-66		O	1	H
I-67		O	1	H
I-68		S	1	H
I-69		O	1	H
I-70		O	1	MeO
I-71		O	1	C1
I-72		O	2	H

【0100】

【表9】

表示化合物 番号	X	Y	m	R
I-73		O	3	H
I-74		S	1	H
I-75		S	4	Et
I-76		O	1	H
I-77		S	1	H
I-78		O	1	H
I-79		O	3	H
I-80		O	1	H
I-81		O	1	H

【0101】

【表10】

表示化合物 番号	X	Y	m	R
I-82		O	↓	H
I-83		O	↑	H
I-84		O	↑	H
I-85		O	↓	H
I-86		O	↑	H
I-87		O	↑	H
I-88		O	↑	H
I-89		O	↑	H
I-90		O	↑	H

【0102】

【表11】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-91		O	I	H
I-92		O	I	H
I-93		O	I	H
I-94		O	I	H
I-95		O	I	H
I-96		O	I	H
I-97		O	I	H
I-98		O	I	H
I-99		O	I	H

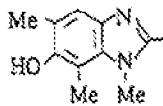
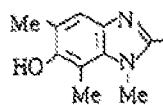
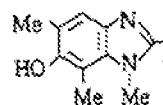
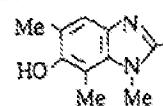
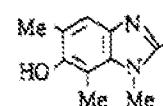
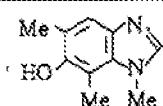
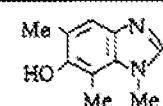
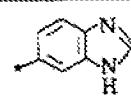
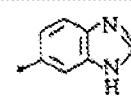
【0103】

【表12】

表示化合物 番号	X	Y	m	R
I-100		O	1	H
I-101		O	1	H
I-102		O	1	H
I-103		O	1	H
I-104		O	1	H
I-105		O	1	H
I-106		O	1	H
I-107		O	1	H
I-108		O	1	H

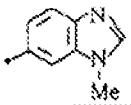
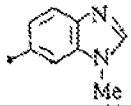
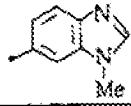
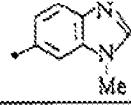
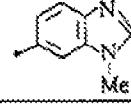
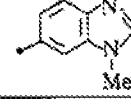
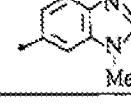
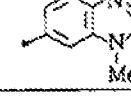
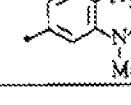
【0104】

【表13】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-109		O	1	H
I-110		O	2	H
I-111		O	3	H
I-112		S	1	H
I-113		O	1	Me
I-114		O	1	MeO
I-115		O	1	Cl
I-116		O	1	H
I-117		S	1	H

【0105】

【表14】

表示化合物 番号	X	Y	m	R
I-118		O	1	H
I-119		O	2	H
I-120		O	3	H
I-121		O	4	H
I-122		O	5	H
I-123		O	1	MeO
I-124		O	1	Cl
I-125		S	1	H
I-126		S	3	H

【0106】

【表15】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-127		O	1	H
I-128		S	1	H
I-129		O	1	H
I-130		O	1	Cl
I-131		O	1	H
I-132		S	1	H
I-133		O	1	H
I-134		O	1	H
I-135		O	3	H

【0107】

【表16】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-136		S	I	H
I-137		O	I	H
I-138		O	I	H
I-139		O	I	H
I-140		S	I	H
I-141		O	I	H
I-142		O	I	H
I-143		O	I	H
I-144		O	I	H

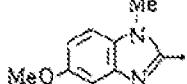
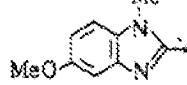
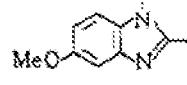
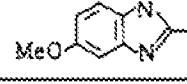
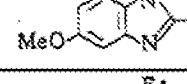
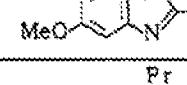
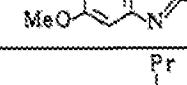
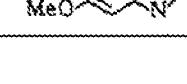
【0108】

【表17】

表示化合物 番号	X	Y	m	R
I-145		S	1	H
I-146		O	1	H
I-147		O	2	H
I-148		O	3	H
I-149		O	4	H
I-150		O	5	H
I-151		S	1	H
I-152		S	2	H
I-153		O	1	Me

【0109】

【表18】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-154		O	2	Me
I-155		O	1	F
I-156		O	1	Cl
I-157		O	1	H
I-158		O	2	H
I-159		O	1	MeO
I-160		S	1	H
I-161		O	1	H
I-162		S	1	H

【0110】

【表19】

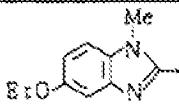
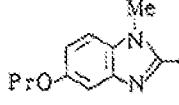
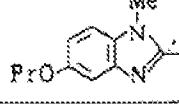
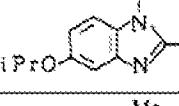
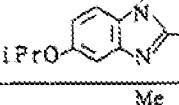
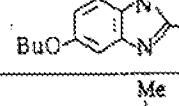
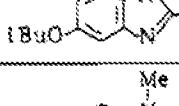
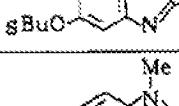
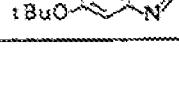
例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-163		O	1	H
I-164		O	1	H
I-165		S	1	H
I-166		O	1	H
I-167		O	1	MeO
I-168		O	1	Cl
I-169		O	2	H
I-170		O	3	H
I-171		S	1	H

【0111】

【表20】

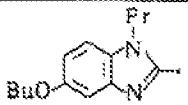
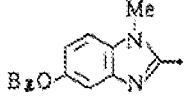
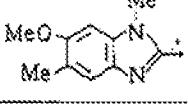
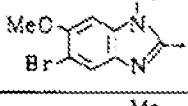
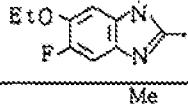
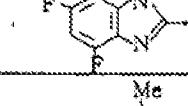
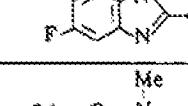
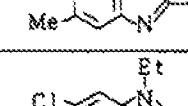
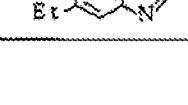
71

72

例示化合物 番号	K	Y	m	R
I-172		S	4	Et
I-173		O	1	H
I-174		S	1	H
I-175		O	1	H
I-176		O	3	H
I-177		O	1	H
I-178		O	1	H
I-179		O	1	H
I-180		O	1	H

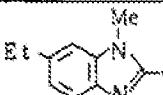
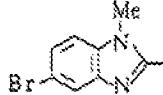
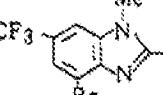
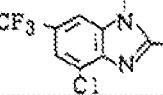
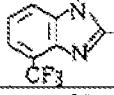
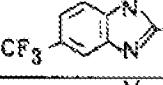
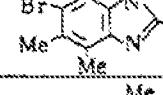
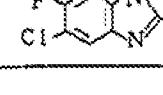
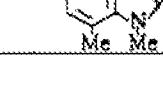
【0112】

【表21】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-181		O	1	H
I-182		O	1	H
I-183		O	1	H
I-184		O	1	H
I-185		O	1	H
I-186		O	1	H
I-187		O	1	H
I-188		O	1	H
I-189		O	1	H

【0113】

【表22】

表示化合物 番号	X	Y	m	R
I-190		O	1	H
I-191		O	1	H
I-192		O	1	H
I-193		O	1	H
I-194		O	1	H
I-195		O	1	H
I-196		O	1	H
I-197		O	1	H
I-198		O	2	H

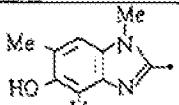
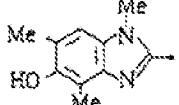
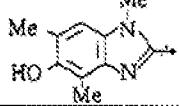
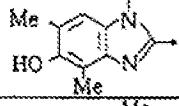
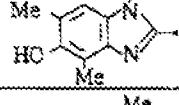
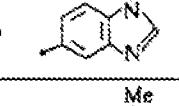
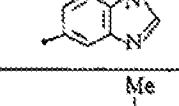
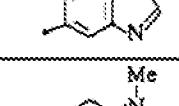
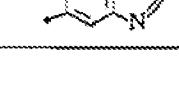
【0114】

【表23】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-199		O	1	H
I-200		O	1	H
I-201		O	1	H
I-202		O	1	H
I-203		O	1	H
I-204		O	1	H
I-205		O	1	H
I-206		O	1	H
I-207		O	2	H

【0115】

【表24】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
1-208		O	3	H
1-209		S	1	H
1-210		O	1	Me
1-211		O	1	MeO
1-212		O	1	Cl
1-213		O	1	H
1-214		O	2	H
1-215		O	3	H
1-216		O	4	H

【0116】

【表25】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
1-217		O	s	H
1-218		O	l	MeO
1-219		O	l	Cl
1-220		S	l	H
1-221		S	3	H
1-222		O	l	H
1-223		S	l	H
1-224		O	l	H
1-225		O	l	Cl

【0117】

【表26】

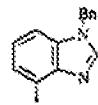
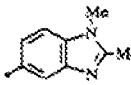
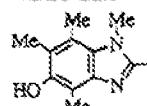
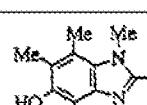
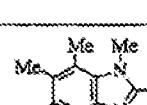
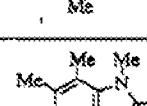
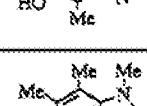
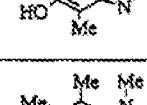
例示化合物 番号	X	Y	m	R
1-226		O	1	H
1-227		S	1	H
1-228		O	1	H
1-229		O	1	H
1-230		O	3	H
1-231		S	1	H
1-232		O	1	H
1-233		O	1	H
1-234		O	1	H

【0118】

【表27】

85

86

例示化合物 番号	X	Y	m	R
I-235		S	1	H
I-236		O	1	H
I-237		O	1	H
I-238		O	2	H
I-239		O	3	H
I-240		O	4	H
I-241		S	1	H
I-242		O	1	MeO

【0119】

【表28】

87

88

録示化合物 番号	X	Y	m	R
1-243		O	1	Cl
1-244		O	1	F
1-245		O	1	CF ₃
1-246		O	1	Br
1-247		O	1	H
1-248		O	2	H
1-249		O	1	MeO

【0120】

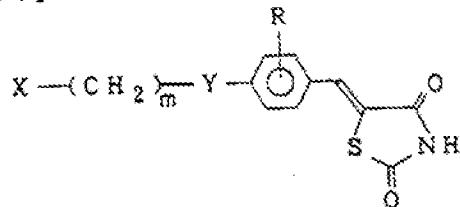
* * 【表29】

録示化合物 番号	X	Y	m	R
1-250		O	1	H

表2

【0121】

【化10】



【0122】

【表30】

40

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-1		O	1	H
2-2		O	2	H
2-3		O	3	H
2-4		O	4	H
2-5		O	5	MeO
2-6		S	1	H
2-7		O	1	MeO
2-8		O	1	Cl
2-9		O	1	Me

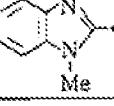
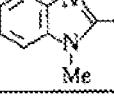
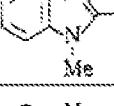
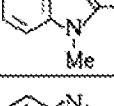
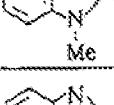
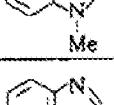
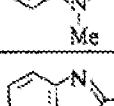
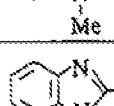
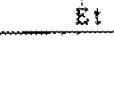
【0123】

【表31】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-10		S	1	MeO
2-11		O	1	H
2-12		O	2	H
2-13		O	3	H
2-14		O	4	H
2-15		O	5	H
2-16		S	1	H
2-17		S	2	H
2-18		O	1	MeO

【0124】

【表32】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-19		O	1	EtO
2-20		O	1	Cl
2-21		O	1	F
2-22		O	1	Me
2-23		O	1	iPr
2-24		O	2	Et
2-25		S	1	Cl
2-26		S	1	Me
2-27		O	1	H

【0125】

【表33】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-28		O	2	H
2-29		O	3	tBu
2-30		O	1	Me
2-31		O	1	MeO
2-32		S	1	H
2-33		S	1	PrO
2-34		S	1	Me
2-35		O	1	H
2-36		O	3	H

【0126】

【表34】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-37		O	1	F
2-38		S	1	H
2-39		O	1	H
2-40		O	2	H
2-41		S	1	H
2-42		S	5	C1
2-43		O	1	H
2-44		O	4	H
2-45		S	1	H

【0127】

【表35】

99

100

表示化合物 番号	X	Y	m	R
2-46		O	1	H
2-47		O	2	H
2-48		S	1	H
2-49		O	1	H
2-50		O	2	H
2-51		O	3	H
2-52		O	4	H
2-53		O	5	H
2-54		S	1	H

【0128】

【表36】

101

102

表示化合物 番号	X	Y	m	R
2-55		S	2	H
2-56		O	1	Me
2-57		O	1	MeO
2-58		O	1	F
2-59		O	1	Cl
2-60		O	1	H
2-61		O	2	H
2-62		O	1	MeO
2-63		S	1	H

【0129】

【表37】

103

104

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-64		O	1	H
2-65		S	1	H
2-66		O	1	H
2-67		O	1	H
2-68		S	1	H
2-69		O	1	H
2-70		O	1	MeO
2-71		O	1	Cl
2-72		O	2	H

【0130】

【表38】

105

106

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-73		O	3	H
2-74		S	1	H
2-75		S	4	Et
2-76		O	1	H
2-77		S	1	H
2-78		O	1	H
2-79		O	3	H
2-80		O	1	H
2-81		O	1	H

【0131】

【表39】

107

108

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-82		O	I	H
2-83		O	I	H
2-84		O	I	H
2-85		O	I	H
2-86		O	I	H
2-87		O	I	H
2-88		O	I	H
2-89		O	I	H
2-90		O	I	H

【0132】

【表40】

109

110

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-91		O	I	H
2-92		O	I	H
2-93		O	I	H
2-94		O	I	H
2-95		O	I	H
2-96		O	I	H
2-97		O	I	H
2-98		O	I	H
2-99		O	I	H

【0133】

【表41】

III

112

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-100		O	I	H
2-101		O	I	H
2-102		O	I	H
2-103		O	I	H
2-104		O	I	H
2-105		O	I	H
2-106		O	I	H
2-107		O	I	H
2-108		O	I	H

【0134】

【表42】

113

114

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-109		O	1	H
2-110		O	2	H
2-111		O	3	H
2-112		S	1	H
2-113		O	1	Me
2-114		O	1	MeO
2-115		O	1	Cl
2-116		O	1	H
2-117		S	1	H

【0135】

【表43】

115

116

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-118		O	1	H
2-119		O	2	H
2-120		O	3	H
2-121		O	4	H
2-122		O	5	H
2-123		O	1	MeO
2-124		O	1	Cl
2-125		S	1	H
2-126		S	3	H

【0136】

【表44】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-127		O	1	H
2-128		S	1	H
2-129		O	1	H
2-130		O	1	Cl
2-131		O	1	H
2-132		S	1	H
2-133		O	1	H
2-134		O	1	H
2-135		O	3	H

【0137】

【表45】

119

120

表示化合物 番号	X	Y	m	R
2-136		S	↓	H
2-137		O	↓	H
2-138		O	↓	H
2-139		O	↓	H
2-140		S	↓	H
2-141		O	↓	H
2-142		O	↓	H
2-143		O	↓	H
2-144		O	↓	H

【0138】

【表46】

121

122

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-145		S	1	H
2-146		O	1	H
2-147		O	2	H
2-148		O	3	H
2-149		O	4	H
2-150		O	5	H
2-151		S	1	H
2-152		S	2	H
2-153		O	1	Me

【0139】

【表47】

123

124

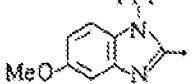
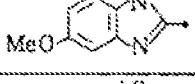
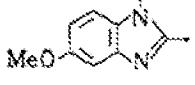
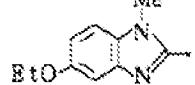
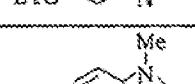
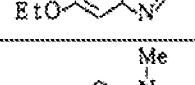
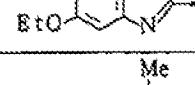
例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-154		O	2	Me
2-155		O	1	P
2-156		O	1	Cl
2-157		O	1	H
2-158		O	2	H
2-159		O	1	MeO
2-160		S	1	H
2-161		O	1	H
2-162		S	1	H

【0140】

【表48】

125

126

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-163		O	1	H
2-164		O	1	H
2-165		S	1	H
2-166		O	1	H
2-167		O	1	MeO
2-168		O	1	Cl
2-169		O	2	H
2-170		O	3	H
2-171		S	1	H

【0141】

【表49】

127

128

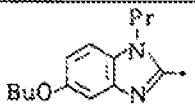
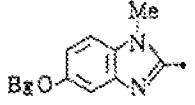
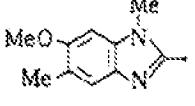
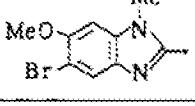
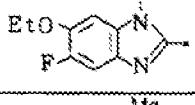
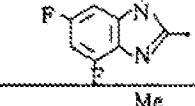
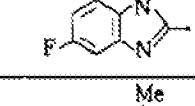
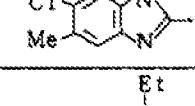
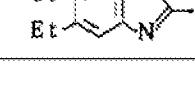
例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-172		S	4	Et
2-173		O	1	H
2-174		S	1	H
2-175		O	1	H
2-176		O	3	H
2-177		O	1	H
2-178		O	1	H
2-179		O	1	H
2-180		O	1	H

【0142】

【表50】

129

130

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-181		O	I	H
2-182		O	I	H
2-183		O	I	H
2-184		O	I	H
2-185		O	I	H
2-186		O	I	H
2-187		O	I	H
2-188		O	I	H
2-189		O	I	H

【0143】

【表51】

131

132

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-190		O	1	H
2-191		O	1	H
2-192		O	1	H
2-193		O	1	H
2-194		O	1	H
2-195		O	1	H
2-196		O	1	H
2-197		O	1	H
2-198		O	2	H

【0144】

【表52】

133

134

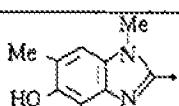
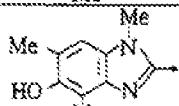
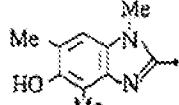
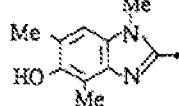
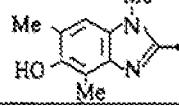
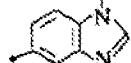
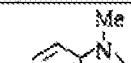
表示化合物 番号	X	Y	m	R
2-199		O	1	H
2-200		O	1	H
2-201		O	1	H
2-202		O	1	H
2-203		O	1	H
2-204		O	1	H
2-205		O	1	H
2-206		O	1	H
2-207		O	2	H

【0145】

【表53】

135

136

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-208		O	3	H
2-209		S	1	H
2-210		O	1	Me
2-211		O	1	MeO
2-212		O	1	Cl
2-213		O	1	H
2-214		O	2	H
2-215		O	3	H
2-216		O	4	H

【0146】

【表54】

137

138

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-217		O	s	H
2-218		O	t	MeO
2-219		O	t	Cl
2-220		S	t	H
2-221		S	s	H
2-222		O	t	H
2-223		S	t	H
2-224		O	t	H
2-225		O	t	Cl

【0147】

【表55】

139

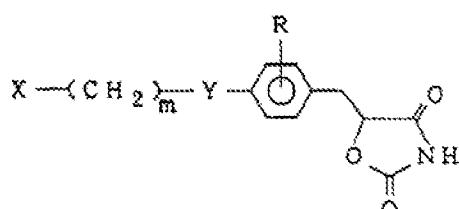
140

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-226		O	1	H
2-227		S	1	H
2-228		O	1	H
2-229		O	1	H
2-230		O	3	H
2-231		S	1	H
2-232		O	1	H
2-233		O	1	H
2-234		O	1	H

【0148】

* * 【表56】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
2-235		S	1	H
2-236		O	1	H

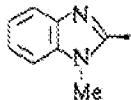
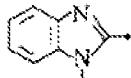
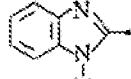
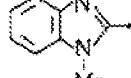
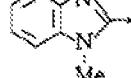
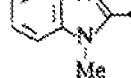
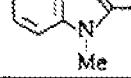
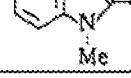
表3
【0149】
【化11】

【表57】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-1		O	1	H
3-2		O	2	H
3-3		O	3	H
3-4		O	4	H
3-5		O	5	MeO
3-6		S	1	H
3-7		O	1	MeO
3-8		O	1	Cl
3-9		O	1	Me

【0151】

【表58】

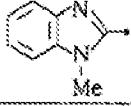
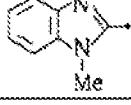
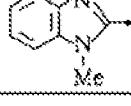
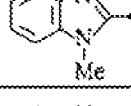
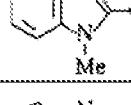
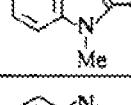
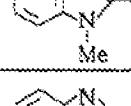
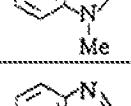
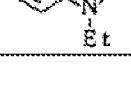
録示化合物 番号	X	Y	m	R
3-10		S	1	MeO
3-11		O	1	H
3-12		O	2	H
3-13		O	3	H
3-14		O	4	H
3-15		O	5	H
3-16		S	1	H
3-17		S	2	H
3-18		O	1	MeO

【0152】

【表59】

145

146

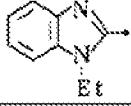
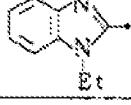
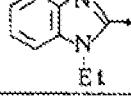
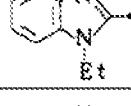
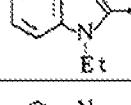
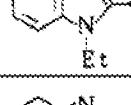
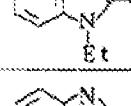
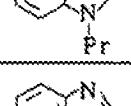
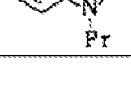
例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-19		O	i	EtO
3-20		O	i	Cl
3-21		O	i	F
3-22		O	i	Me
3-23		O	i	iPr
3-24		O	2	Et
3-25		S	i	Cl
3-26		S	i	Me
3-27		O	i	H

【0153】

【表60】

147

148

例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-28		O	2	H
3-29		O	3	tBu
3-30		O	1	Me
3-31		O	1	MeO
3-32		S	1	H
3-33		S	1	PrO
3-34		S	1	Me
3-35		O	1	H
3-36		O	3	H

【0154】

【表61】

149

150

表示化合物 番号	X	Y	m	R
3-37		O	1	F
3-38		S	1	H
3-39		O	1	H
3-40		O	2	H
3-41		S	1	H
3-42		S	5	Cl
3-43		O	1	H
3-44		O	4	H
3-45		S	1	H

【0155】

【表62】

151

152

例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-46		O	1	H
3-47		O	3	H
3-48		S	1	H
3-49		O	1	H
3-50		O	2	H
3-51		O	3	H
3-52		O	4	H
3-53		O	5	H
3-54		S	1	H

【0156】

【表63】

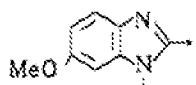
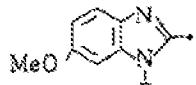
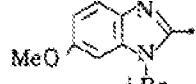
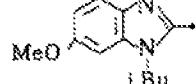
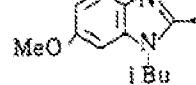
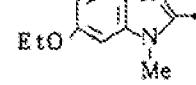
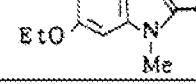
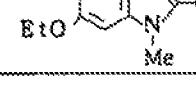
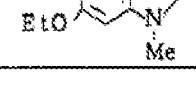
例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-55		S	z	H
3-56		O	1	Me
3-57		O	1	MeO
3-58		O	1	F
3-59		O	1	Cl
3-60		O	1	H
3-61		O	2	H
3-62		O	1	MeO
3-63		S	1	H

【0157】

【表64】

155

156

例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-64		O	1	H
3-65		S	1	H
3-66		O	1	H
3-67		O	1	H
3-68		S	1	H
3-69		O	1	H
3-70		O	1	MeO
3-71		O	1	Cl
3-72		O	2	H

【0158】

【表65】

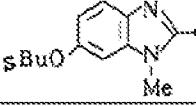
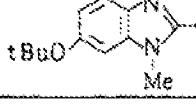
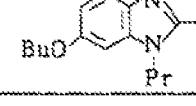
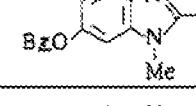
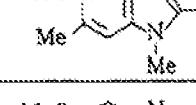
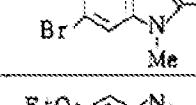
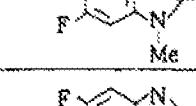
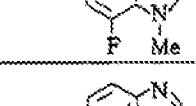
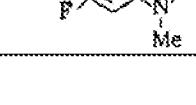
例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-73		O	3	H
3-74		S	1	H
3-75		S	4	Et
3-76		O	1	H
3-77		S	1	H
3-78		O	1	H
3-79		O	3	H
3-80		O	1	H
3-81		O	1	H

【0159】

【表66】

159

160

例示化合物 番号	K	Y	m	R
3-82		O	I	H
3-83		O	I	H
3-84		O	I	H
3-85		O	I	H
3-86		O	I	H
3-87		O	I	H
3-88		O	I	H
3-89		O	I	H
3-90		O	I	H

【0160】

【表67】

161

162

例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-91		O	I	H
3-92		O	I	H
3-93		O	I	H
3-94		O	I	H
3-95		O	I	H
3-96		O	I	H
3-97		O	I	H
3-98		O	I	H
3-99		O	I	H

【0161】

【表68】

163

例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-100		O	I	H
3-101		O	I	H
3-102		O	I	H
3-103		O	I	H
3-104		O	I	H
3-105		O	I	H
3-106		O	I	H
3-107		O	I	H
3-108		O	I	H

【0162】

【表69】

例示化合物 番号	X	Y	m	R
3-109		O	1	H
3-110		O	2	H
3-111		O	3	H
3-112		S	1	H
3-113		O	1	Me
3-114		O	1	MeO
3-115		O	1	Cl
3-116		O	1	H
3-117		S	1	H

【0163】

【表70】